BUNDESREPUBLIK DE

PRIORITY



RECEIVED 18 JAN 2005

WIPO

POT

Prioritätsbescheinigung über die Einreichung einer Patentanmeldung

Aktenzeichen:

103 61 001.4

Anmeldetag:

23. Dezember 2003

Anmelder/Inhaber:

BASF Aktiengesellschaft, 67063 Ludwigshafen/DE

Bezeichnung:

3-Trifluormethylpicolinsäureanilide und ihre

Verwendung als Fungizide

IPC:

C 07 D, A 01 N



München, den 26. November 2004 **Deutsches Patent- und Markenamt** Der Präsident

Im Auftrag

Hoiß

A 9161

BEST AVAILABLE COPY

3-Trifluormethylpicolinsäureanilide und ihre Verwendung als Fungizide

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide mit fungizider Wirksamkeit und ihre Verwendung als Fungizide, d.h. zur Bekämpfung von Schadpilzen.

Hetarylanilide mit fungizider Wirksamkeit sind Gegenstand zahlreicher Patentanmeldungen (siehe beispielsweise WO 86/02641, JP 01313402, US 4,877,441, EP 371950, WO 93/11117, EP 545099, DE 4204766, DE 4204768, EP 591699, EP 589301, JP 07145156, JP 08092223, WO 97/08148, WO 98/03500, EP 824099, EP 846416, WO 00/09482, WO 01/42223, EP 1110454, EP 1110956, WO 01/49664, JP 2001-302605, JP 2001-302605, WO 02/08195, WO 02/08197, WO 02/38542, WO 02/59086, WO 02/064562, WO 03/010149, WO 03/66609, WO 03/66610, WO 03/69995, WO 03/74491 und WO 03/70705). Die dort beschriebenen Hetarylanilide können jedoch, insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen, nicht in vollem Umfang zufrieden stellen.

Aus JP 58096069 sind fungizid wirksame Picolinsäureanilide der allgemeinen Formel

worin R für CH₃ oder CF₃ steht, bekannt. Die fungizide Wirksamkeit dieser Verbindungen ist jedoch nicht zufriedenstellend.

Der vorliegenden Erfindung liegt daher die Aufgabe zugrunde weitere fungizid wirkende Verbindungen bereitzustellen, die die Nachteile der aus dem Stand der Technik bekannten Verbindungen überwinden und insbesondere eine verbesserte Wirkung bei niedrigen Aufwandmengen zeigen. Außerdem sollten diese Verbindungen eine gute Nutzpflanzenverträglichkeit aufweisen und möglichst keine oder nur eine geringe Schädlichkeit gegenüber tierischen Nützlingen zeigen.

Diese Aufgabe konnten gelöst werden durch die im Folgenden beschriebenen 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I und durch ihre landwirtschaftlich verträglichen Salze.

20030975 Wer/135 . 23.12.2003

M/44344

25

30

Die vorliegende Erfindung betrifft daher 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I,

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & W & (R^6)_n \\
R^2 & CF_3 & X-R^5
\end{array}$$
(I)

5

worin n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

10

O, S oder direkte Bindung

X W

O oder S;

R¹, R², R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

15

R⁴ Wasserstoff, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei wobei die Wasserstoffatome in den 3 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

20

 R^5

unsubstituiertes C_4 - C_{12} -Alkyl, C_3 - C_{12} -Cycloalkyl, C_3 - C_{12} -Alkenyl, C_5 - C_{12} -Cycloalkenyl, C_3 - C_{12} -Alkinyl, C_3 - C_{12} -Cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, wobei die 5 letztgenannten Gruppen jeweils 1, 2 oder 3 Substituenten R^9 aufweisen können, und wobei die Wasserstoffatome in den 5 letztgenannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können; C_1 - C_{12} -Halogenalkyl, C_1 - C_{12} -Alkyl, das 1, 2 oder 3 Substituenten R^{11} auf-

25

weist, eine Gruppe -C(R¹⁰)=NOR³,

Phenyl, Phenyl- C_1 - C_6 -alkyl, Phenyl- C_2 - C_6 -alkenyl, Phenyl- C_2 - C_6 -alkinyl, Phenyloxy- C_1 - C_6 -alkyl, Phenyloxy- C_2 - C_6 -alkenyl, Phenyloxy- C_2 - C_6 -alkinyl, wobei der Alkyl-, Alkenyl- und der Alkinyl-Teil in den 6 zuletzt genannten Gruppen 1, 2, 3 oder 4 Substituenten R^{11} aufweisen kann und der Phenylring in den 7 zuletzt genannten Gruppen 1, 2, 3 oder 4 Reste R^7 tragen

30

R⁶ die für R¹ genannten, von Wasserstoff verschiedenen Bedeutungen;

 R^7

C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆- Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-

35

Alkenyloxy, C_2 - C_4 -Alkinyl, C_2 - C_4 -Alkinyloxy, wobei die Wasserstoffatome in

diesen 7 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können, OH, Halogen, Nitro, CN, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, – C(O)R¹², NR¹³R¹⁴, -C(O)NR¹³R¹⁴, -C(S)NR¹³R¹⁴, -C(R¹⁰)=NOR⁸, Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, Phenoxy, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, C₁-C₆-Alkyl-Phenyl, wobei die Wasserstoffatome des Alkylteils teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und der Phenylring 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, wobei zwei an benachbarte Kohlenstoffatome gebundene Reste R⁷ auch für eine Alkylenkette mit 3 bis 5 Gliedern stehen können, worin 1 oder 2 nicht benachbarte CH₂-Gruppen auch durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein können und worin ein Teil oder alle Wasserstoffe durch Halogen ersetzt sein können; C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, wobei , wobei die Wasserstoffatome in diesen 4 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können,

Phenyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei Phenyl in den zwei letztgenannten Resten 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann; C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_2 - C_8 -Alkenyloxy, C_2 - C_8 -Alkinyloxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_8 -alkoxy, C_1 - C_{12} -Alkyl, C_3 - C_{12} -Cycloalkyl, C_2 - C_{12} -Alkenyl, C_5 - C_{12} -Cycloalkenyl, C_3 - C_{12} -Cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, wobei die Wasserstoffatome in den 9 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁷ genannten Gruppen aufweisen kann,

C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können, oder Halogen;

Wasserstoff, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₂-C₄-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 7 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

R¹³, R¹⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

40 und die landwirtschaftlich brauchbaren Salze von I.

10

15

5

 R^8

. . .

25

" R¹¹

R12.

30

Die vorliegende Erfindung betrifft außerdem die Verwendung der 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I und deren landwirtschaftlich verträglich Salze als Fungizide sowie diese enthaltende Pflanzenschutzmittel.

5

Die vorliegende Erfindung betrifft weiterhin ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen (Schadpilzen), das dadurch gekennzeichnet ist, dass man die Schadpilze, deren Lebensraum oder die von ihnen freizuhaltenden Pflanzen, Flächen, Materialien oder Räume mit einer fungizid wirksamen Menge eines 3-

10 Trifluormethylpicolinsäureanilids der allgemeinen Formel I und/oder einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I behandelt.

15

Die 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der Formel I können je nach Art der Substituenten ein oder mehrere Chiralitätszentren aufweisen und liegen dann als Enantiomerenoder Diastereomerengemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomere oder Diastereomere als auch deren Gemische. Geeignete Verbindungen der Formel I umfassen auch alle möglichen Stereoisomere (cis/trans-Isomere) und Gemische davon.

Unter landwirtschaftlich brauchbaren Salzen kommen vor allem die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die fungizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen. So kommen als Kationen insbesondere die Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium, Magnesium und Barium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie das Ammoniumion, das gewünschtenfalls ein bis vier C₁-C₄-Alkylsubstituenten und/oder einen Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise
 Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Phosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat, sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat. Sie können durch Reaktion von I mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

40

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Variablen werden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die jeweiligen Substituenten stehen. Die Bedeutung C_n-C_m gibt die jeweils mögliche Anzahl von Kohlenstoffatomen in dem jeweiligen Substituenten oder Substituententeil an. Sämtliche Kohlenstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Phenylalkyl-, Alkenyl-, Halogenalkenyl-, Phenylalkenyl-, Alkinyl-, Halogenalkinyl- und Phenylalkinyl-Teile können geradkettig oder verzweigt sein. Halogenierte Substituenten tragen vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder lod.

10

5

Ferner stehen beispielsweise:

 C_1 - C_4 -Alkyl sowie die Alkylteile in Alkoxyalkyl, Alkylsulfonyl und Alkylthio für: CH_3 , C_2H_5 , CH_2 - C_2H_5 , $CH(CH_3)_2$, CH_3 , $CH(CH_3)_2$, $CH(CH_3)_3$;

15

20

C₁-C₄-Halogenalkyl: für einen C₁-C₄-Alkylrest wie vorstehend genannt, worin die Wasserstoffatome teilweise, z.B. 1, 2 oder 3, oder vollständig durch Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod, insbesondere durch Chlor und/oder Fluor und speziell durch Fluor substituiert sind, also z.B. CH₂F, CH₂, CF₃, CH₂CI, CH(Cl)₂, C(Cl)₃, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Indethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, C₂F₅, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Tri-chlorpropyl, CH₂-C₂F₅, CF₂-C₂F₅, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 4-Brombutyl oder Nona-

30

25 .

C₁-C₁₂-Alkyl: für einen gesättigten Kohlenwasserstoffrest mit 1 bis 12 C-Atomen, z.B. für einen C₁-C₄-Alkylrest wie-vorstehend genannt, oder für z.B. n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl oder 1-Ethyl-2-methylpropyl, vorzugsweise für CH₃, C₂H₅, CH₂-C₂H₅, CH(CH₃)₂, n-Butyl, C(CH₃)₃, n-Pentyl, n-Hexyl, n-Heptyl oder n-Octyl;

40

fluorbutyl;

. .

6

C₁-C₁₂-Halogenalkyl: für einen C₁-C₁₂-Alkylrest wie vorstehend genannt, worin die Wasserstoffatome teilweise, z.B. 1, 2 oder 3, oder vollständig durch Halogen, insbesondere durch Chlor und/oder Fluor und speziell durch Fluor substituiert sind, also z.B. für einen der unter C₁-C₄-Halogenalkyl genannten Reste oder für 5-Fluor-1-pentyl, 5-Chlor-1-pentyl, 5-Brom-1-pentyl, 5-Iod-1-pentyl, 5,5,5-Trichlor-1-penyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluor-1-hexyl, 6-Chlor-1-hexyl, 6-Brom-1-hexyl, 6-Iod-1-hexyl, 6,6,6-Trichlor-1-hexyl oder Dodecafluorhexyl;

C₂-C₄-Alkenyl sowie die Alkenylteile in Alkenyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Buten-1-yl, 1-Buten-2-yl, 1-Buten-3-yl, 2-Buten-1-yl, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl, 2-Methyl-prop-1-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl;

C₂-C₁₂-Alkenyl. ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. für C₂-C₄-Alkenyl wie vorstehend genannt sowie z. B. für: n-Penten-1-yl, n-Penten-2-yl, n-Penten-3-yl, n-Penten-4-yl,

1-Methyl-but-1-en-1-yl, 2-Methyl-but-1-en-1-yl, 3-Methyl-but-1-en-1-yl,

1-Methyl-but-2-en-1-yl, 2-Methyl-but-2-en-1-yl, 3-Methyl-but-2-en-1-yl,

1-Methyl-but-3-en-1-yl, 2-Methyl-but-3-en-1-yl, 3-Methyl-but-3-en-1-yl,

1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yl,

1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yl, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl,

n-Hex-1-en-1-yl, n-Hex-2-en-1-yl, n-Hex-3-en-1-yl, n-Hex-4-en-1-yl,

n-Hex-5-en-1-yl, 1-Methyl-pent-1-en-1-yl, 2-Methyl-pent-1-en-1-yl,

3-Methyl-pent-1-en-1-yl, 4-Methyl-pent-1-en-1-yl, 1-Methyl-pent-2-en-1-yl,

2-Methyl-pent-2-en-1-yl, 3-Methyl-pent-2-en-1-yl, 4-Methyl-pent-2-en-1-yl,

1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl, 3-Methyl-pent-3-en-1-yl,

4-Methyl-pent-3-en-1-yl, 1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl,

3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl,

1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yl,

1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl,

1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,

1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl,

2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,

2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl,

3.3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-1-en-1-yl, 1-Ethyl-but-2-en-1-yl,

1-Ethyl-but-3-en-1-yl, 2-Ethyl-but-1-en-1-yl, 2-Ethyl-but-2-en-1-yl,

40 2-Ethyl-but-3-en-1-yl, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl,

15

. 20

. 25

30

- 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl oder 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl;
- C2-C4-Alkinyl sowie die Alkinylteile in Alkinyloxy: geradkettige oder verzweigte 5 Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl (=Propargyl), 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl und 1-Methyl-2-propinyl;
- C₂-C₁₂-Alkinyl für geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 12 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, 10 z.B. Ethinyl, Prop-1-in-1-yl, Prop-2-in-1-yl, n-But-1-in-1-yl, n-But-1-in-3-yl, n-But-1-in-4-yl, n-But-2-in-1-yl, n-Pent-1-in-1-yl, n-Pent-1-in-3-yl, n-Pent-1-in-4-yl, n-Pent-1-in-5-yl, n-Pent-2-in-1-yl, n-Pent-2-in-4-yl, n-Pent-2-in-5-yl, 3-Methyl-but-1-in-3-yl, 3-Methyl-but-1-in-4-yl, n-Hex-1-in-1-yl, n-Hex-1-in-3-yl, 15 n-Hex-1-in-4-yl, n-Hex-1-in-5-yl, n-Hex-1-in-6-yl, n-Hex-2-in-1-yl, n-Hex-2-in-4-yl, ா-Hex-2-in-5-yl, n-Hex-2-in-6-yl, n-Hex-3-in-1-yl, n-Hex-3-in-2-yl, வக்க அக்கு கொண்டு இ 1. 3-Methyl-pent-1-in-1-yl, 3-Methyl-pent-1-in-3-yl, 3-Methyl-pent-1-in-4-yl, 1-med-1-8/methyl-pent-1-in-4-yl, 3-Methyl-pent-1-in-5-yl, 4-Methyl-pent-1-in-1-yl, 4-Methyl-pent-2-in-4-yl und 4-Methyl-pent-2-in-5-yl:
 - C₁-C₄-Alkoxy: für OCH₃, OC₂H₅, OCH₂-C₂H₅, OCH(CH₃)₂, n-Butóxy, OCH(CH₃)-C₂H₅, OCH₂-CH(CH₃)₂ oder OC(CH₃)₃;
- ein Teil, z.B. 1, 2 oder 3 oder alle Wasserstoffatome durch Halogen, insbesondere durch Chlor und/oder Fluor und speziell durch Fluor substituiert sind, also z.B. OCH₂F, OCH₂, OCF₃, OCH₂CI, OCH(CI)₂, OC(CI)₃, Chlorfluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-lodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 30 2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluorethoxy, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy, 35 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy oder Nonafluorbutoxy, vorzugsweise für OCHF2, OCF3, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy oder 2,2,2-Trifluorethoxy;

C₁-C₄-Halogenalkoxy: für einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend genannt, worin 🦠

C₃-C₆-Cycloalkyl: für Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl;

M/44344

40

20

25 ...

C₃-C₁₂-Cycloalkyl für einen mono-, bi- oder tricylischen Kohlenwasserstoffrest, z.B. für einen C₃-C₆-Cycloalkylrest wie vorstehend genannt oder für Cycloheptyl, Cylcooctyl, Bicyclo[2.2.1]heptyl, Bicyclo[2.2.2]octyl, Bicyclo[3.2.1]octyl, Bicyclo[3.2.1]oct lo[3.3.0]octyl, Bicyclo[4.3.0]nonyl, Bicyclo[4.4.0]decyl oder Adamantyl;

5

- C_3-C_{12} -Cycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl für C_1-C_4 -Alkyl, welches mit C_3-C_{12} -Cycloalkyl substituiert ist: z.B. Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cycloheptylmethyl, Cyclooctylmethyl, 2-(Cyclopropyl)ethyl,
 - 2-(Cyclobutyl)ethyl, 2-(Cyclopentyl)ethyl, 2-(Cyclohexyl)ethyl,
- 2-(Cycloheptyl)ethyl, 2-(Cyclooctyl)ethyl, 3-(Cyclopropyl)propyl, 10
 - 3-(Cyclobutyl)propyl, 3-(Cyclopentyl)propyl, 3-(Cyclohexyl)propyl,
 - 3-(Cycloheptyl)propyl, 3-(Cyclooctyl)propyl, 4-(Cyclopropyl)butyl,
 - 4-(Cyclobutyl)butyl, 4-(Cyclopentyl)butyl, 4-(Cyclohexyl)butyl,
 - 4-(Cycloheptyl)butyl, 4-(Cyclooctyl)butyl;

C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl: für C₁-C₄-Alkyl, welches mit C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist, z.B. für Methoxymethyl, Ethoxymethyl, 1- oder 2-Methoxyethyl, 1- oder 2-Ethoxyethyl, 1-, 2- oder 3-Methoxypropyl;

- C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy: für C₁-C₄-Alkoxy, welches mit C₁-C₄-Alkoxy substitu-20 iert ist, z.B. für Methoxymethoxy, Ethoxymethoxy, 1- oder 2-Methoxyethoxy, 1oder 2-Ethoxyethoxy, 1-, 2- oder 3-Methoxypropoxy;
- Phenyl-C₁-C₆-alkyl: für C₁-C₆-Alkyl, welches mit Phenyl substituiert ist, z.B. für Benzyl, 1- oder 2-Phenylethyl, 1-, 2- oder 3-Phenylpropyl; 25
 - Phenyloxy-C₁-C₆-alkyl: für C₁-C₆-Alkyl, welches mit Phenoxy, substituiert ist, z.B. für Phenoxymethyl, 1- oder 2-Phenoxyethyl, 1-, 2- oder 3-Phenoxypropyl;
- Phenyl-C₂-C₆-alkenyl: für C₂-C₆-Alkenyl, welches mit Phenyl, substituiert ist, z.B. 30 für 1- oder 2-Phenylethenyl, 1-Phenylprop-2-en-1-yl, 3-Phenyl-1-propen-1-yl, 3-Phenyl-2-propen-1-yl, 4-Phenyl-1-buten-1-yl oder 4-Phenyl-2-buten-1-yl;
- Phenyloxy-C2-C6-alkenyl: für C2-C6-Alkenyl, welches mit Phenoxy, substituiert ist, z.B. für 1- oder 2-Phenyloxyethenyl, 1-Phenyloxyprop-2-en-1-yl, 3-Phenyloxy-1-35 propen-1-yl, 3-Phenyloxy-2-propen-1-yl, 4-Phenyloxy-1-buten-1-yl oder 4-Phenyloxy-2-buten-1-yl;
- Phenyl-C₂-C₆-alkinyl: für C₂-C₆-Alkinyl, welches mit Phenyl, substituiert ist, z.B. für 1-Phenylprop-2-in-1-yl, 3-Phenyl-1-propin-1-yl, 3-Phenyl-2-propin-1-yl, 4-40

Phenyl-1-butin-1-yl oder 4-Phenyl-2-butin-1-yl.

- Phenyloxy-C₂-C₆-alkinyl: für C₂-C₆-Alkinyl, welches mit Phenoxy, substituiert ist, z.B. für 1-Phenyloxyprop-2-in-1-yl, 3-Phenyloxy-1-propin-1-yl, 3-Phenyloxy-2-propin-1-yl, 4-Phenyloxy-1-butin-1-yl oder 4-Phenyloxy-2-butin-1-yl.

Im Hinblick auf die fungizide Wirksamkeit sind Anilide der allgemeinen Formel I bevorzugt, worin die Variablen R¹ bis R⁶ unabhängig voneinander und insbesondere in Kombination die folgenden Bedeutungen aufweisen:

R¹, R², R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl. Insbesondere stehen 1, 2 oder bevorzugt alle Reste R¹, R² und R³ für Wasserstoff;

R⁴ Wasserstoff, Methyl, OH oder Methoxy, insbesondere Wasserstoff; Wasserstoff, Wethyl, OH oder Methoxy, insbesondere Wasserstoff; Wasserstoff, Wa

R⁵ eine der folgenden Bedeutungen:

unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₂-C₁₂-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und die Wasserstoffatome in C₃-C₁₂-Cycloalkyl teilweise oder vollständig durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können;

C₁-C₁₂-Halogenalkyl, insbesondere C₁-C₄-Fluoralkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, insbesondere C₁-C₄-Fluoralkoxy-C₁-C₄-alkyl;

Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei der Phenylring mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Resten R⁷ substituiert sein kann und insbesondere 0, 1, 2 oder 3 Reste R⁷ aufweist; oder

 $-C(C_1-C_4-Alkyl)=NO-R^8$, wobei die Wasserstoffatome der $C_1-C_4-Alkyl$ gruppe teilweise, z.B. 1-, 2- oder 3-fach oder vollständig durch Halogen substituiert sein können; und

10

20

25

30

20

30

35

10

- unabhängig voneinander: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, R^6 C₁-C₄-Halogenalkoxy, oder Halogen, speziell Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Methoxy, Trifluormethoxy oder Difluormethyl.
- Die Variable R7 ist insbesondere ausgewählt unter C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-5 Halogenalkyl, C1-C4-Halogenalkoxy, Nitro, CN oder Halogen, speziell Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Methoxy, Trifluormethoxy oder Difluormethyl.
- Die Variable R⁸ ist vorzugsweise ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆- Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in diesen 5 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können, Halogen, Nitro, CN, Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, Phenoxy, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, C₁-C₆-Alkyl-Phenyl, wobei die Wasserstoffatome des Alkylteils teilweise oder vollständig durch Ha-15 logen substituiert sein können und der Phenylring 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, insbesondere unter C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆- Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, wobei , wobei die Wasserstoffatome in diesen 4 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können, Phenyl oder Benzyl, wobei Phenyl in den zwei letztgenannten Resten 1, 2 oder 3 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann.

Im Hinblick auf ihre fungizide Wirksamkeit sind solche Anilide der Formel I bevorzugt, worin n = 0 ist.

Die Variable W steht insbesondere für Sauerstoff. 25

> Im Hinblick auf die fungizide Wirksamkeit der Anilide I; steht X in Formel I für eine direkte Bindung oder Sauerstoff. In einer ersten besonders bevorzugten Ausführungsform der Erfindung steht X für Sauerstoff. In einer anderen besonders bevorzugten Ausführungsform steht X für eine direkte Bindung. Sofern R⁵ für unsubstituiertes Alkyl steht, ist X insbesondere eine direkte Bindung.

> Im Hinblick auf ihre fungizide Wirksamkeit sind solche Anilide der Formel I bevorzugtl, in denen die Gruppe X-R⁵ in ortho- oder meta-Position und insbesondere in ortho-Position zum Amidstickstoff gebunden ist. Hierunter sind besonders diejenigen Anilide der Formel I bevorzugt, in denen R1, R2 und R3 jeweils für Wasserstoff stehen, und speziell solche mit n = 0. Hierunter sind solche Anilide besonders bevorzugt, in denen R⁵ eine der folgenenden Bedeutungen aufweist.

- unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂ Cycloalkenyl, C₂-C₁₂-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und die Wasserstoffatome in C₃-C₁₂-Cycloalkyl teilweise oder vollständig durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können;
- C₁-C₁₂-Halogenalkyl, insbesondere C₁-C₄-Fluoralkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl, insbesondere C₁-C₄-Fluoralkoxy-C₁-C₄-alkyl;
- Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei der Phenylring mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Resten R⁷ substituiert sein kann und insbesondere 0, 1, 2 oder 3 Reste R⁷ aufweist; oder
 - -C(C₁-C₄-Alkyl)=NO-R⁸, wobei die Wasserstoffatome der C₁-C₄-Alkylgruppe teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können.

Hierbei haben R⁷ und R⁸ insbesondere die als bevorzugt angegebenen Bedeutungen, Wisteht insbesondere für Sauerstoff.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung als Fungizide und Wirkstoffe zur Bekämpfung von Schädlingen die in den folgenden Tabelle 1 bis 6 zusammengestellten Einzelverbindungen bevorzugt, die unter die allgemeinen Formeln la, Ib und Ic fallen, wobei Verbindungen der allgemeinen Formel la besonders bevorzugt sind.

Tabelle A

_	_
-,	•
_	•

5

R⁵	
Cyclopropyl	in the state of the
n-C ₄ H ₉	
s-C ₄ H ₉	
i–C ₄ H ₉	
t-C ₄ H ₉	
n-C ₅ H ₁₁	
i-C ₅ H ₁₁	
neo-C ₅ H ₁₁	
Cyclopentyl	
n-C ₆ H ₁₃	
Cyclohexyl	
Cyclobutyl	
CH₂CH₂CI	
	R^{5} $Cyclopropyl$ $n-C_{4}H_{9}$ $s-C_{4}H_{9}$ $i-C_{4}H_{9}$ $t-C_{4}H_{9}$ $n-C_{5}H_{11}$ $i-C_{5}H_{11}$ $neo-C_{5}H_{11}$ $Cyclopentyl$ $n-C_{6}H_{13}$ $Cyclohexyl$ $Cyclobutyl$

•		12
	Nr.	R ⁵
	14.	(CH ₂) ₄ Cl
	15.	2-Methoxyeth-1-yl
	16.	2-Ethoxyeth-1-yl
	17.	2-Isopropoxyeth-1-yl
	18.	2-Vinyloxyeth-1-yl
	19.	Allyloxyeth-1-yl
	20.	2-Trifluormethoxyeth-1-yl
	21.	Prop-2-in-1-yl
* . *	22.	But-2-in-1-yl
in with the transfer The Mariana	23.	But-3-in-1-yl
and the state of t	24.	3-Chlorprop-2-in-1-yl
	25.	Benzyl
	26.	1–Naphthyl–CH₂
W - M 2	27.	2-Naphthyl-CH ₂
	28,	2-Phenoxyeth-1-yl
	29.	2–(2'–Chlorphenoxy)eth–1–yl
Swephyte tide	: 30.	2-(3'-Chlorphenoxy)eth-1-yl
and the second	31.	2-(4'-Chlorphenoxy)eth-1-yl
•	32.	2-(3',5'-Dichlorphenoxy)eth-1-yl
	33.	2-(2'-Cyanophenoxy)eth-1-yl
	34.	2–(3'–Cyanophenoxy)eth–1–yl
	35.	2 (.)
	36.	2-(2'-Methylphenoxy)eth-1-yl
	37.	2-(3'-Methylphenoxy)eth-1-yl
A STATE OF THE STA	38.	2-(4'-Methylphenoxy)eth-1-yl
	39.	2-(3'-t-Butylphenoxy)eth-1-yl
	40.	2–(4'–t–Butylphenoxy)eth–1–yl
	41.	2–(2'–Nitrophenoxy)eth–1–yl
	42.	2–(3'–Nitrophenoxy)eth–1–yl
	43.	2-(4'-Nitrophenoxy)eth-1-yl
	44.	2–(2'-Methoxyphenoxy)eth–1–yl
	45.	2–(3'–Methoxyphenoxy)eth–1–yl
	46.	2-(4'-Methoxyphenoxy)eth-1-yl
	47.	2-(2'-Trifluormethylphenoxy)eth-1-yl
	48.	2-(3'-Trifluormethylphenoxy)eth-1-yl
	49.	2-(4'-Trifluormethylphenoxy)eth-1-yl
	50.	2-Phenyleth-1-yl

Nr.	R ⁵
51.	2-(2'-Chlorphenyl)eth-1-yl
52.	2-(3'-Chlorphenyl)eth-1-yl
53.	2-(4'-Chlorphenyl)eth-1-yl
54.	2-(3',5'-Dichlorphenyl)eth-1-yl
55.	2-(2'-Cyanophenyl)eth-1-yl
56.	2-(3'-Cyanophenyl)eth-1-yl
57.	2-(4'-Cyanophenyi)eth-1-yl
58.	2-(2'-Methylphenyl)eth-1-yl
59.	2-(3'-Methylphenyl)eth-1-yl
60.	2-(4'-Methylphenyl)eth-1-yl
61.	2-(2'-Methoxyphenyl)eth-1-yl
62.	2-(3'-Methoxyphenyl)eth-1-yl
63.	2-(4'-Methoxyphenyl)eth-1-yl
64.	2-(2'-Trifluormethylphenyl)eth-1-yl
65.	2-(3'-Trifluormethylphenyl)eth-1-yl
66.	2-(4'-Trifluormethylphenyl)eth-1-yl
67.	C ₆ H ₅
68.	2-F-C ₆ H ₄
69.	3-F-C ₆ H ₄
70.	4-F-C ₆ H ₄
71.	2,3-F ₂ -C ₆ H ₃
72.	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃
73.	2,5-F ₂ -C ₆ H ₃
74.	2,6-F ₂ -C ₆ H ₃
	3,4-F ₂ -C ₆ H ₃
76.	3,5-F ₂ -C ₆ H ₃
77.	2–Cl–C ₆ H ₄
78.	3CIC ₆ H ₄
79.	4-CI-C ₆ H ₄
80.	2,3-Cl ₂ -C ₆ H ₃
81.	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
82.	2,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
83.	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃
84.	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂
87.	2,3,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂

	14
Nr.	R⁵
88.	2,3,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
89.	2,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂
90.	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
91.	3,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂
92.	2-Br-C ₆ H ₄
93.	3-Br-C ₆ H ₄
94.	4-Br-C ₆ H ₄
95.	2,3-Br ₂ -C ₆ H ₃
96.	2,4-Br ₂ -C ₆ H ₃
97.	2,5-Br ₂ -C ₆ H ₃
98.	2,6-Br ₂ -C ₆ H ₃
, 99.	3,4-Br ₂ -C ₆ H ₃
100.	3,5-Br ₂ -C ₆ H ₃
101.	2-F, 3-CI-C ₆ H ₃
102.	2–F, 4–Cl–C ₆ H ₃
· 103.	2-F, 5-CI-C ₆ H ₃
104.	2F, 3BrC ₆ H ₃
105.	2–F, 4–Br–C ₆ H ₃
106.	2–F, 5–Br–C ₆ H ₃
107.	2CI, 3BrC ₆ H ₃
108.	2–Cl, 4–Br–C ₆ H ₃
109.	2–Cl, 5–Br–C ₆ H ₃
110.	3–F, 4–CI–C ₆ H ₃
111.	3–F, 5–CI–C ₆ H ₃
112.	3–F, 6–CI–C ₆ H ₃
113.	3–F, 4–Br–C ₆ H ₃
114.	3–F, 5–Br–C ₆ H ₃
115.	3–F, 6–Br–C ₆ H ₃
116.	3–CI, 4–Br–C ₆ H ₃
117.	3–CI, 5–Br–C ₆ H ₃
118.	3–CI, 6–Br–C ₆ H ₃
119.	4-F, 5-CI-C ₆ H ₃
120.	4–F, 6–CI–C ₆ H ₃
121.	4–F, 5–Br–C ₆ H ₃
122.	4–F, 6–Br–C ₆ H ₃
123.	4–Cl, 5–Br–C ₆ H ₃
124.	5-F, 6-CI-C ₆ H ₃

	15		_	
Nr.	R⁵			
125.	5-F, 6-Br-C ₆ H ₃			
126.	5–Cl, 6–Br–C ₆ H ₃			
127.	3-Br, 4-Cl, 5-Br-C ₆ H ₂			
128.	2-CN-C ₆ H ₄			
129.	3-CN-C ₆ H ₄			
130.	4-CN-C ₆ H ₄			
131.	2-NO ₂ -C ₆ H ₄			
132.	3-NO ₂ -C ₆ H ₄			
133.	4-NO ₂ -C ₆ H ₄			
134.	2-CH ₃ -C ₆ H ₄		•	
135.	3-CH ₃ -C ₆ H ₄			1. 15%
136.	4-CH ₃ -C ₆ H ₄			٠, .
137.	2,3-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃		. 1	18.0-18.0
138.	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃			2.5 (0)
139.	2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃		. • 11. • • • •	1 (5-4)4
140.	2,6-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	·		
141.	3,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃			
142.	3,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃		1.7 3.75	10,84,03
143.	2-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄		.: '	
144.	3-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄	· · · · · ·		
145.	4-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄		: .	,
146.	2-i-C ₃ H ₇ C ₆ H ₄	• ;		
. 147.	3-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄	· :		
148.	4-i-C ₃ H ₇ C ₆ H ₄			. t (* 1.53)
149.	3-tertC ₄ H ₉ -C ₆ H ₄			; ·· };
150.	4-tertC ₄ H ₉ -C ₆ H ₄			
151.	2-Vinyl-C ₆ H ₄			
152.	3-Vinyl-C ₆ H ₄			
153.	4-Vinyl-C ₆ H ₄			·
154.	2-Allyl-C ₆ H ₄			<u></u> .
155.	3-AllyI-C ₆ H₄			· · · ·
156.	4-Allyl-C ₆ H ₄			
157.	2-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄		, <u></u>	
158.	3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄			
159.	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄			
160.	3-CH ₃ , 5-tertC ₄ H ₉ -C ₆ H ₃			
161.	2-OH-C ₆ H ₄			
		_		



	10
Nr.	R ⁵
162.	3-OH-C ₆ H ₄
163.	4-OH-C ₆ H ₄
164.	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄
165.	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄
166.	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄
167.	2,3-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
168.	2,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
169.	2,5-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
. 170.	3,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
171.	3,5-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
172.	3,4,5–(OCH ₃) ₃ –C ₆ H ₂
173.	2-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
174.	3-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
175.	4-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
176.	2-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
177.	3-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
178.	4-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
179.	2-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
180.	3-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
181.	4-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄
182.	$4-O-(n-C_4H_9)-C_6H_4$
183.	3-O-(t-C ₄ H ₉)-C ₆ H ₄
184.	$4-O-(t-C_4H_9)-C_6H_4$
185.	2-O-Allyl-C ₆ H ₄
186	3-O-Allyl-C ₆ H ₄
187.	4-O-Allyl-C ₆ H ₄
188.	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
189.	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
190.	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
191.	2-Acetyl-C ₆ H ₄
192.	3-Acetyl-C ₆ H ₄
193.	4-Acetyl-C ₆ H ₄
194.	2–Methoxycarbonyl–C ₆ H ₄
195.	3–Methoxycarbonyl–C ₆ H₄
196.	4–Methoxycarbonyl–C ₆ H₄
197.	2-Aminocarbonyl-C ₆ H ₄
198.	3–Aminocarbonyl–C ₆ H ₄

lr.	R ⁵		
199.	4–Aminocarbonyl–C ₆ H ₄		<u></u>
200.	2–Dimethylaminocarbonyl–C ₆ H₄		
201.	3-Dimethylaminocarbonyl-C ₆ H ₄		
202.	4-Dimethylaminocarbonyl-C ₆ H ₄		
203.	2-(N-Methylaminocarbonyl)-C ₆ H ₄		
204.	3-(N-Methylaminocarbonyl)C ₆ H ₄	·	
205.	4–(N–Methylaminocarbonyl)–C ₆ H ₄		
206.	2-H ₂ N-C ₆ H ₄		·
207.	3-H ₂ N-C ₆ H ₄		
208.	4-H ₂ N-C ₆ H ₄		1000
209.	2-Aminothiocarbonyl-C ₆ H ₄		<u> </u>
210.	3–Aminothiocarbonyl–C₅H₄		
211.	4–Aminothiocarbonyl–C₀H₄	·	
212.	2-Methoxyiminomethyl-C ₆ H₄	, ·	
213.	3–Methoxyiminomethyl–C ₆ H ₄	<u> </u>	
214.	4–Methoxylminomethyl–C ₆ H ₄		
215.	3,4-Methylendioxy-C ₆ H ₃		
216.	3,4-Difluormethylendioxy-C ₆ H ₃		1, 1, 1, 1, 3
217.	2,3-Methylendioxy-C ₆ H ₃		. 5 3
218.	2-(1'-Methoxyiminoeth-1'-yl)-C ₆ H ₄	1,1	· · · · · ·
219.	3-(1'-Methoxyiminoeth-1'-yl)-C ₆ H ₄		<u> </u>
220.	4-(1'-Methoxyiminoeth-1'-yl)-C ₆ H ₄		<u> </u>
221.	2-SCH ₃ -C ₆ H ₄		<u> </u>
222.	3-SCH ₃ -C ₆ H ₄		
223.	4-SCH ₃ -C ₆ H ₄		
224.	2-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄		• • • • • • •
225.	3-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	<u> </u>	
226.	4-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄		·
227.	2-OCF ₃ -C ₆ H ₄		
228.	3-OCF ₃ -C ₆ H ₄		
229.	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄		
230.	2-OCHF ₂ -C ₆ H ₄		
231.	3-OCHF ₂ -C ₆ H ₄		
232.	4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄		
233.	3-CF ₃ , 4-OCF ₃ -C ₆ H ₃		
234.	2–NHCH₃–C₅H₄		
235.	3-NHCH₃-C ₆ H ₄		



		18
	Nr.	R ⁵
·	236.	4-NHCH ₃ -C ₆ H ₄
Ì	237.	2-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄
	238.	3-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄
	239.	4-N(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄
	240.	2–Ethoxycarbonyl–C ₆ H₄
	241.	3–Ethoxycarbonyl–C ₆ H ₄
	242.	4–Ethoxycarbonyl–C _θ H ₄
	243.	2-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
	244.	3-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
	245.	4-CH ₂ CH ₂ F-C ₆ H ₄
	246	2-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
**************************************	247.	3-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
Treated to	248.	4-CH ₂ CF ₃ -C ₆ H ₄
		2-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
The second secon		3-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
STORE OF CASE SECTION	251.	4-CF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄
	252.	2-CHF ₂ -C ₆ H ₄
	253.	3-CHF ₂ -C ₆ H ₄
the west of comments to the control of	254.	4-CHF ₂ -C ₆ H ₄
	255.	2–(1'–Oxo–n–prop–1–yl)–C ₆ H ₄
	256.	3-(1'-Oxo-n-prop-1-yl)-C ₆ H ₄
	257.	4-(1'-Oxo-n-prop-1-yl)-C ₆ H ₄
	. 258.	2-(1'-Oxo-iso-prop-1-yl)-C ₆ H ₄
and the second s	259.	3-(1'-Oxo-iso-prop-1-yl)-C ₆ H ₄
	260.	4-(1'-Oxo-iso-prop-1-yl)-C ₆ H ₄
	261.	3-Cyclopropyl-C ₆ H ₄
	262.	4–Cyclopropyl–C ₆ H ₄
	263.	4-Cyclohexyl-C ₆ H ₄
•	264.	-C≡ CH
	265.	-C≡ C-Cl
	266.	-C≡ C-Br
	267.	-C≡ C-CH₃
	268.	-C≡ C-C ₆ H ₅
	269.	-C≡ C-[2-Cl-C ₆ H ₄]
·	270.	-C≡ C-[4-Cl-C ₆ H ₄]
	271.	-C≡ C-[2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃]
	272.	-C≡ C-[2-CH ₃ -C ₆ H ₄]
	273.	-C≡ C-[4-CH ₃ -C ₆ H ₄]

Nr.	R ⁵
274.	$-C \equiv C - [2,4 - (CH_3)_2 - C_6H_3]$
275.	-C≡ C-[2-Cl, 4-CH ₃ -C ₆ H ₃]
276.	-C≡ C-[2-CH ₃ , 4-Cl-C ₆ H ₃]
277.	-C≡ C-[3-CF ₃ -C ₆ H ₄]
278.	-C≡ C-[3-Cl, 5-CF ₃ -C ₆ H ₃]
279.	-C≡ C-[2-OCH ₃ -C ₆ H ₄]
280.	-C≡ C-[4-OCH ₃ -C ₆ H ₄]
281.	-C≡ C-[2,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃]
282.	-C≡ C-[2-Cl, 4-OCH ₃ -C ₆ H ₃]
283.	-C≡ C-[2-OCH ₃ , 4-Cl-C ₆ H ₃]
284.	-C≡ C-[3-OCHF ₂ -C ₆ H ₄]
285.	-C≡ C-[3-Cl, 5-OCHF ₂ -C ₆ H ₃]
286.	cyclopentyl
287.	1-CH₃-cyclopentyl
288.	2-CH ₃ -cyclopentyl
289. *******	3-CH ₃ -cyclopentyl
290.	2,3-(CH ₃) ₂ -cyclopentýl
291.	1-CI-cyclopentyl
292:	2-Ci-cyclopentyl
293:	3-CI-cyclopentyl
294.	2-CH ₃ , 3-Cl-cyclopentyl
295.	2,3-Cl ₂ -cyclopentyl
296.	cyclohexyl
297.	1-CH ₃ -cyclohexyl
298.	2-CH ₃ -cyclohexyl
299.	3-CH ₃ -cyclohexyl
300	2,3-(CH ₃) ₂ -cyclohexyl
301.	3,3-(CH ₃) ₂ -cyclohexyl
302.	1-CI-cyclohexyl
303.	2-CI-cyclohexyl
304.	3-CI-cyclohexyl
305.	2-CH ₃ , 3-Cl-cyclohexyl
306.	2,3-Cl₂-cyclohexyl
307.	CH ₂ -C≡ C-H
308.	CH₂-C≡ C-Cl
309.	CH ₂ -C≡ C-Br
310.	CH ₂ -C≡ C-J
311.	CH ₂ -C≡ C-CH ₃



	20
Nr.	R ⁵
312.	CH ₂ -C≡ C-CH ₂ CH ₃
313.	CH ₂ CH ₂ -C≡ C-H
314.	CH ₂ CH ₂ -C≡ C-Cl
315.	CH₂CH₂-C≡ C-Br
316.	CH ₂ CH ₂ -C≡ C-J
317.	CH ₂ CH ₂ -C≡ C-CH ₃
318.	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -C≡ C-H
319.	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -C≡ C-CI
320.	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -C≡ C-Br
321.	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -C≡ C-J
322.	CH ₂ CH ₂ CC≡ C-CH ₃
***************************************	CH(CH ₃)-C≡ C-H
324.	CH(CH₃)-C≡ C-Cl
325.	CH(CH₃)-C≡ C-Br
326.	CH(CH ₃)-C≡ C-J
327.	CH(CH ₃)-C≡ C-CH ₃ · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
328	-C≡ C-[4-F-C ₆ H ₄]
329.	n-Heptyl
**330.	n-Octyl Andrew Strategy and the strategy
331.	Vinyl
332.	1-Methylvinyl
333.	2-Methylvinyl
334.	Allyl
335.	2-Methylallyl
336.	2-Ethylallyl
,337 338.	1-Methylallyl
339.	1-Ethylallyl, 1-Methyl-2-butenyl
340.	1-Ethyl-2-butenyl
341.	1-Isopropyl-2-butenyl
342.	1-n-Butyl-2-butenyl
343.	1-Methyl-2-pentyl
344.	1,4-Dimethyl-2-pentenyl
345.	Propargyl
346.	2-Butinyl
347.	3-Butinyl
348.	2-Cyclopentenyl
349.	1-Cyclopentenyl
L	1 Oyolopoinoliji

	21		
Nr.	R⁵		
350.	1-Cyclohexenyl		
351.	2-Cyclohexenyl		
352.	-CH₂F		
353.	-CHF ₂		7
354.	-CF ₃		
355.	-CH ₂ -CHF ₂		,
356.	-CH ₂ -CF ₃		
357.	-CHF-CF₃		•
358.	-CF ₂ -CHF ₂		
359.	-CF ₂ -CF ₃		
360.	CH ₂ -CF ₂ -CHF ₂		
361.	CH ₂ -CF ₂ -CF ₃		- 1 5.0
362.	CF ₂ -CF ₂ -CF ₃		
363.	-CF ₂ -CHF-CF ₃ Common		
364.	-CH ₂ (CF ₂) ₂ -CF ₃	<u>.</u>	
365.	-CF ₂ (CF ₂) ₂ -CF ₃	1.7	~ -C(C)
366.	-CH ₂ (CF ₂) ₃ -CF ₃	s. Y s. 1	(1-10) in the
367.	-CF ₂ (CF ₂) ₃ -CF ₃		<u>- 1 -0% (0</u>
368.	-CF ₂ -CF ₂ OMethyl	n meta e pr	
369.	-CF ₂ -CF ₂ OEthyl		
370.	CF ₂ -CF ₂ O-n-Propyl	- : - <u>- : : : : : : : : : : : : : : : :</u>	Specific (
371.	CF ₂ -CF ₂ O-n-Butyl		·. ·.
372.	-CF ₂ -(CF ₂) ₂ OMethyl	· · · ·	
373.	-CF ₂ -(CF ₂) ₂ OEthyl		Various de
374.	-CF ₂ -(CF ₂) ₂ O-n-Propyl		
375.	-CF ₂ -(CF ₂) ₂ O-n-Butyl	•	13.5
376.	-(CF ₂) ₂ O-(CF ₂) ₂ OMethyl		
377.	-(CF ₂) ₂ O-(CF ₂) ₂ OEthyl		
378.	-(CF ₂) ₂ .O-(CF ₂) ₂ O-n-Propyl		
379.	-(CF ₂) ₂ O-(CF ₂) ₂ O-n-Butyl		
380.	-CH ₂ -CHCl ₂		
381.	-CH ₂ -CCl ₃		
382.	-CCl ₂ -CHCl ₂		
383.	-CH ₂ CFCl ₂		
384.	-CH ₂ -CCIF ₂		
385.	-CH ₂ -CCl ₂ -CCl ₃		<u> </u>
386. 387.	-CH ₂ -CF ₂ -CHF-CF ₂ -CCIF ₂ Methoxyiminomethyl		· · ·
307.	INIGHTOXYITHHOMEUTY)		

		22
Nr.		R⁵
	388.	Ethoxyiminomethyl
	389.	iso-Propyloxyiminomethyl
	390.	Allyloxyiminomethyl
-	391.	Phenoxyiminomethyl
	392.	Benzyloxyiminomethyl
	393.	1-Methoxyimino-eth-1-yl
	394.	1-Ethoxyimino-eth-1-yl
	395.	1-iso-Propyloxyimino-eth-1-yl
	396.	1-Allyloxyimino-eth-1-yl
·	397.	1-Phenoxyimino-eth-1-yl
	398.	1-Benzyloxyimino-eth-1-yl
	399.	2-Ethoxyiminomethyl-phenyl
	400.	3-Ethoxyiminomethyl-phenyl
	401.	4-Ethoxyiminomethyl-phenyl
	402.	2-(1-Ethoxyimino-eth-1-yl)-phenyl
	403.	3-(1-Ethoxyimino-eth-1-yl)-phenyl
1.	404.	4-(1-Ethoxyimino-eth-1-yl)-phenyl
	405.	2-(1-Ethoxyimino-n-prop-1-yl)-phenyl
	406.	3-(1-Ethoxyimino-n-prop-1-yl)-phenyl
	407.	4-(1-Ethoxyimino-n-prop-1-yl)-phenyl
	408.	2-(iso-Propyloxyiminomethyl)-phenyl
	409.	3-(iso-Propyloxyiminomethyl)-phenyl
	410.	4-(iso-Propyloxyiminomethyl)-phenyl
	411	2-(1-iso-Propyloxyimino-eth-1-yl)-phenyl
	412	3-(1-iso-Propyloxyimino-eth-1-yl)-phenyl
'	413.	4-(1-iso-Propyloxyimino-eth-1-yl)-phenyl
	414.	2-(1-Ethoxyimino-n-prop-1-yl)-phenyl
	415.	3-(1-Ethoxyimino-n-prop-1-yl)-phenyl
	416.	4-(1-Ethoxyimino-n-prop-1-yl)-phenyl
	417.	2-(Allyloxyiminomethyl)-phenyl
	418.	3-(Allyloxyiminomethyl)-phenyl
	419.	4-(Allyloxyiminomethyl)-phenyl
	420.	2-(1-Allyloxyimino-eth-1-yl)-phenyl
	421.	3-(1-Allyloxyimino-eth-1-yl)-phenyl
	422.	4-(1-Allyloxyimino-eth-1-yl)-phenyl
	423.	2-(1-Allyloxyimino-n-prop-1-yl)-phenyl
	424.	3-(1-Allyloxyimino-n-prop-1-yi)-phenyl
	425.	4-(1-Allyloxyimino-n-prop-1-yl)-phenyl

Tabelle 1:

Verbindungen der allgemeinen Formel la;

(la)

5

worin X eine direkte Bindung ist und R⁵ eine in Tabelle A angegebene Bedeutung aufweist.

Tabelle 2:



Verbindungen der allgemeinen Formel Ia, worin X für O steht und R⁵ eine in der Tabelle A angegebene Bedeutung aufweist.

Tabelle 3:

15

Verbindungen der allgemeinen Formel ib,

$$X R^5$$
 (lb)

20

25

worin X eine direkte Bindung ist und R^5 eine in der Tabelle A angegebene Bedeutung aufweist.

Tabelle 4:

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, worin X für O steht und R⁵ eine in der Tabelle A angegebene Bedeutung aufweist.

Tabelle 5:

Verbindungen der allgemeinen Formel Ic,

$$\begin{array}{c|c} S & & \\ \hline N & & \\ \hline N & & \\ CF_3 & & \\ \hline R^5 \end{array}$$
 (Ic)

worin X eine direkte Bindung ist und R^5 eine in der Tabelle A angegebene Bedeutung aufweist.

Tabelle 6:

5

10

Verbindungen der allgemeinen Formel Ic, worin X für O steht und R⁵ eine in der Tabelle A angegebene Bedeutung aufweist.

Die 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I mit W = 0 und R⁴ = H können gemäß der in Schema 1 gezeigten Synthese nach literaturbekannten Verfahren durch Umsetzung aktivierter 3-Trifluormethylpicolinsäurederivate der allgemeinen Formel II mit einem Anilin III hergestellt werden [Houben-Weyl: "Methoden der organ: Chemie", Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, Band E5, S. 941-1045.]. Aktivierte Carbonsäurederivate sind beispielsweise Halogenide, Aktivester, Anhydride, Azide, z.B. Chloride, Fluoride, Bromide, para-Nitrophenylester, Pentafluorphenylester, N-Hydroxysuccinimidester und Hydroxybenzotriazol-1-yl-ester.

20 Schema 1:

25

In Schema 1 steht L für eine geeignete nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, beispielsweise für Halogenid, Aktivester-Rest, einen Anhydrid-Rest, Azid, z.B. Chlorid, Fluorid, Bromid, para-Nitrophenyloxy, Pentafluorphenyloxy, einen von N-Hydroxysuccinimid oder von Hydroxybenzotriazol-1-yl abgeleiteten Rest.

Die 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I können außerdem durch Umsetzung der freien Säuren IIa mit einem gegebenenfalls N-substituierten Anilin IIIa in Gegenwart eines Kupplungsreagenzes hergestellt werden (Schema 2).

5 Schema 2:

15

20

25

Kupplungsreagenzien können beispielsweise sein:

- Kupplungsreagenzien auf Carbodiimid-Basis, z.B. N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid [J.C. Sheehan, G.P. Hess, J. Am. Chem. Soc. 1955, 77, 1067], N-(3-Dimethylaminopropyl)-N'-ethyl-carbodiimid;
- Kupplungsreagenzien, die gemischte Anhydride mit Kohlensäureestern bilden,
 z.B. 2-Ethoxy-1-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin [B. Belleau, G. Malek, J. Armer. Chem. Soc. 1968, 90, 1651.], 2-iso-Butyloxy-1-iso-butyloxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin [Y. Kiso, H. Yajima, J. Chem. Soc., Chem. Commun. 1972, 942.];
 Kupplungsreagenzien aus Phosphonium-Basis, z.B. (Benzotriazol-1-yloxy)-tris-(dimethylamino)-phosophonium-hexafluorophosphat [B. Castro, J.R. Domoy, G.
 - (dimethylamino)-phosophonium-nexalluorophosphat [B. Castro, J.R. Domoy, G. Evin, C. Selve, Tetrahedron Lett. 1975, 14, 1219.], (Benzotriazol-1-yl-oxy)-tripyrrolidinophosphoniuim-hexalluorophsophat [J. Coste et.al., Tetrahedron Lett. 1990, 31, 205.];
- Kupplungsreagenzien auf Uroniumbasis bzw. mit Guanidinium-N-oxid-Struktur, z.B. N,N,N',N'-Tetramethyl-O-(1H-benzotriazol-1-yl)-uronium-hexafluorophosphat [R. Knorr, A. Trzeciak, W. Bannwarth, D. Gillessen, Tetrahedron Lett. 1989, 30, 1927.], N,N,N',N'-Tetramethyl-O-(benzotriazol-1-yl)-uronium-tetrafluoroborat, (Benzotriazol-1-yloxy)-dipiperidinocarbenium-hexafluorophosphat [S. Chen, J. Xu, Tetrahedron Lett. 1992, 33, 647.]
- Kupplungsreagenzien, die Säurechloride bilden, z.B. Phosphorsäure-bis-(2-oxo-oxazolidid)-chlorid [J. Diago-Mesequer, Synthesis 1980, 547.].
- Die 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I mit R⁴ = ggf. mit Halogen substituiertem Alkyl oder ggf. mit Halogen substituiertem Cycloalkyl können durch Alkylierung der Amide I (worin R⁴ = Wasserstoff ist und die gemäß Schema 1 oder 2 zugänglich sind) mit geeigneten Alkylierungsreagenzien in Gegenwart von Basen her-

gestellt werden. Verfahren hierzu sind bekannt, z.B. aus J. Am. Chem. Soc. 1952, 74, S.3121, Helv. Chim. Acta, 1974, 57, S 281, Synth. Commun. 1988, 18, S. 2011.

Die 3-Trifluormethylpicolinsäuren IIa können nach literaturbekannten Methoden hergestellt werden z.B. aus den entsprechenden Pyridin-2,3-dicarbonsäuren durch Umsetzung mit Schwefeltetrafluorid in Anlehnung an die in J. Fluorine Chem. 1993, 60, S. 233-237; JP 1980-5059135; US 4803205; oder Khim. Geterotsikl. Soedin 1994, S. 657-659; oder durch Einführung der Carboxylgruppe nach der in Eur. J. Org. Chem. 2002, S. 327-330.

10

5

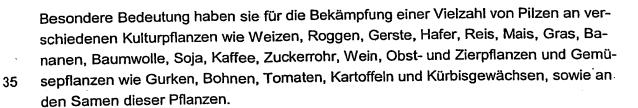
Daraus sind die aktivierten Thiophencarbonsäurederivate II nach literaturbekannten Verfahren synthetisierbar [Houben-Weyl: "Methoden der organ. Chemie", Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, Band E5, S. 587-614, 633-772.]



Die Aniline III und IIIa sind nach literaturbekannten Methoden synthetisierbar [Houben-Weyl: "Methoden der organ. Chemie", Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York; Band XI, Teil 1, S. 9-1005.]

3-Trifluormethylpicolinthioanilide der allgemeinen Formel I mit W = S können durch allgemein bekannte Schwefelungsverfahren aus den entsprechenden Aniliden der Formel I mit X = O hergestellt werden, beispielsweise durch Schwefelung mit P₂S₅ nach J. Am. Chem. Soc. 1951, 73, S. 4988, durch Umsetzung mit Laessons Reagenz nach Heterocycles 2002, 58, S. 203-212; oder Pharmazie 1999, 54 (9), S.645-650.

Die 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I und ihre landwirtschaftlich verträglichen, d.h. brauchbaren Salze eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam
und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.



Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

Alternaria-Arten an Gemüse und Obst,

- Botrytis cinerea (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- Cercospora arachidicola an Erdnüssen,
- Erysiphe cichoracearum und Sphaerotheca fuliginea an Kürbisgewächsen,
- 5 Erysiphe graminis (echter Mehltau) an Getreide,
 - Fusarium- und Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen,
 - Helminthosporium-Arten an Getreide,
 - Mycosphaerella-Arten an Bananen und Erdnüssen,
 - Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten,
- 10 Plasmopara viticola an Reben,
 - Podosphaera leucotricha an Äpfeln,
 - Pseudocercosporella herpotrichoides an Weizen und Gerste,
 - Pseudoperonospora-Arten an Hopfen und Gurken,
 - Puccinia-Arten an Getreide, 🚓 🚋
 - Pyricularia oryzae an Reis,
 - Rhizoctonia-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
 - Septoria nodorum an Weizen,
 - Sphaerotheca fuliginea (Gurkenmehltau) an Gurken,
 - Uncinula necator an Reben,
- 20 Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
 - Venturia-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.
 - Septoria Tritici
 - Pyrenophora-Arten
 - Leptosphaeria Nodorum
- 25 Rhynchosporium-Arten
 - Typhula-Arten.

Die Verbindungen der Formel I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen der Formel I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.



Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Qubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen der Formel I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenolether,

30

35

Service de la

. . . .

30

29

nol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch
Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe
sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie
z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

- 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung
 aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl,

Contract Con

A CONTRACTOR OF THE STATE OF TH

30

das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

- 5 III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).
 - IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).
 - V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
 - VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.Teilen N-Methyl-a-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
 - VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
 - VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gew.-Teilen Wasser

30

35

erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

10 Gew.-Teile der erfindungsgemäßen Verbindung werden in 63 Gew.-Teilen IX. Cyclohexanon, 27 Gew.-Teilen Dispergiermittel (beispielsweise eine Mischung aus 50 Gew.-Teilen des Anlagerungsprodukts von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 50 Gew.-Teilen des Anlagerungsprodukts von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl) gelöst. Die Stammlösung wird anschließend durch Verteilen in Wasser auf die gewünschte Konzentration verdünnt, z.B. auf eine Konzentration im Bereich von 1 bis 100 ppm.

10

5

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

20

25

销售的 / 1 例

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergieroder Emulgiermitttel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

30

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%. Häufig reichen bereits geringe Wirkstoffmengen an Verbindung I in der anwendungsfertigen Zubereitung aus, z.B. 2 bis 200 ppm. Ebenso sind anwendungsfertige Zubereitungen mit Wirkstoffkonzentrationen im Bereich von 0,01 bis 1 % bevorzugt.

35

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

40

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungs-

20030975

gemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden,

- Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.
- Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

15

- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkelmethylenbis-Zinke
- Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
 - heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4- triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
 - N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäure- diamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazolon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-lod-benzoesäure-anilid, N-

35

Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol, a-(2-Chlorphenyl)-a-(4-chlorphenyl)-5pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-15 - thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, িজ কুল ক্রাড্রে Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino∗[a-(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetat, Methyl-E-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yloxy]-phenyl}-3-methoxyachylat, Methyl-E-Commence of the second methoxyimino-[a-(2-

San San San San San San

20

5

10

NO SHOW THE STATE OF

1、多数的多数 (**386**0)多数 (1966) (1 tolyl]-acetamid, Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin, N-[4-Methyl-6-(1propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin, Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril, Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-

phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino-[a-(2,5-dimethylphenoxy)-o-

25

Sage of the sage o

And the second of the second of the acrylsäuremorpholid, (3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methyl- ester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-

30

35

alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3oxazolidin, 3-[3,5-Dichlorphenyl(-5-methyl-5-methoxymethyl]-1,3-oxazolidin-2,4dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-

Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-

Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor-a-(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chior-2,6dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-

aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol.

Herstellungsbeispiele:

5 .

10.

15

25

30

Beispiel 1: 3-Trifluormethyl-picolinsäure-(ortho-cyclohexyl)-anilid:

3-Trifluormethylpyridin-2-carbonsäuremethylester: 1.1

66,8 g (0,4 mol) Pyridin-2,3-dicarbonsäure wurden in einem 0,5 l Autoklaven vorgelegt. Anschließend kondensierte man 120 g (6 mol) wasserfrein Fluorwasserstoff ein und presste 138,4 g (1,28 mol) Schwefeltetrafluorid auf. Man rührte 24 h bei 60 °C. Nach Entspannen gab man 150 ml Methanol in den Autoklaven: und rührte anschliessend 3 h bei 80°C unter Eigendruck. Nach Entspannen gab man den Autoklaveninhalt auf 1000 g Eiswasser, stellte mit 40 gew.-%iger wässriger Kaliumhydroxid-Lösung alkalisch, wusch 3 mal mit 350 ml Methylenchlorid, and the control of the control o trennte die Methylenchloridphase ab, wusch einmal mit 300 ml Wasser und halben was 1900 ml trocknete anschließend die organische Phase mit Magnesiumsulfat: Nach Abdes সংগ্ৰেম আনুন্ত ் tillieren des Lösungsmittels im Vakuum erhielt man einen Rückstande der im Va- ் ுர்க்கி kuum über eine 15 cm-Vigreuxkolonne destilliert wurde. Man erhielt 61,9 g der 🦠 🕬 💮 Titelverbindung als eine Fraktion bei 98-99°C (10 mbar) mit einer GC-Reinheit von_88,7%.

Control Control 1H-NMR (DMSO-d₆): 3,05 ppm (s, 3H, OMe); 7,85 ppm (m, 1H, Pyridin-H); 8,40 ppm (d, 1H, Pyridin-H); 8,95 ppm (d, 1H, Pyridin-H).

3-Trifluormethylpyridin-2-carbonsäure Kaliumsalz:

20 g (0,086 mol) 88,7%iger 3-Trifluormethylpyridin-2-carbonsäuremethylester und 300 ml 20 gew.-%ige wässrige Kaliumhydroxid-Lösung wurden 6 h zum Rückfluss erhitzt. Anschließend stellte man mit wässriger Salzsäure auf pH=5 und engte zur Trockene ein. Der Rückstand wurde zweimal mit 400 ml Methanol ausgekocht. Die Methanol extrakte wurde gesammelt und im Vakuum zur Trockne eingeengt. Auf diese Weise erhielt man 20,2 g der Titelverbindung als Kaliumsalz.

1H-NMR (DMSO-d₆): 7,3 ppm (m, 1H, Pyridin-H); 7,95 ppm (d, 1H, Pyridin-H); 8,6 ppm (d, 1H, Pyridin-H).

3-Trifluormethyl-picolinsäure-(ortho-cyclohexyl)-anilid: In 20 ml Dichlormethan wurden 600 mg ortho-Cyclohexylanilin und 1,04 g 35 Triethylamin gelöst. Man gab 0,72 g 3-Trifluormethylpicolinsäurechlorid zu und rührte 14 h bei Raumtemperatur. Anschließend wurde die Reaktionsmischung je einmal mit wässrigem Natriumhydrogencarbonat und verdünnter Salzsäure und zweimal mit Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat 40

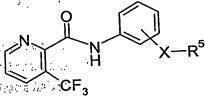
getrocknet und im Vakuum eingeengt. Nach chromatographischer Reinigung des Rückstandes an Kieselgel mit einer Mischung aus Cyclohexan und Methyl-tertbutylether erhält man 740 mg der Zielverbindung mit einem Festpunkt von 111-116°C.

5

angalaga na mas

Die Verbindungen der Beispiele 2 bis 22 (Verbindungen der Formel I') wurden in analoger Weise hergestellt. Ihre physikochemischen Daten sind in Tabelle 1 zusammengestellt:

10 Tabelle 1:



200 - 12 (P) that we will select the tree

Comment of a personal control of the control

الت ال] H		प्रदेश क्षेत्र करिया करिया है। जन्म	
	CF ₃	1、扩张设施	an defeat of	A CANAL CANA
		Position	Festpunkt	Spektroskopische Daten
Bsp.	X-R°	ortho	111-116°C	
1	cyclo-Hexyl	O. a.i.o	Markey Six	IR [cm ⁻¹]: 1703, 1587,
ļ				1576, 1521, 1452, 1433,
1	SUCCUL CH	ortho	Öl	1314, 1298, 1157, 1129,
2	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	Ortho		1067, 1034, 816, 808,
1				757.
	n-Pentyl	ortho	68-73°C	
3 4	4-Chlorphenyl	ortho	132-136°C	
	4-Fluorphenyl	ortho	114-117°C	
5 6	1,1,2,2-Tetrafluorethoxy	ortho	83-86°C	*
	cylco-Pentyl	ortho .	117-122°C	
7	1,1,2,2-Tetrafluorethoxy	meta	89-90°C	
9	-OC(O)NH-tert-butyl	meta	129-131°C	
	n-Hexyloxy	meta	59-60°C	15 1007 1007
10	11-Flexyloxy			IR [cm ⁻¹]: 1697, 1607,
	cyclo-Pentyloxy	meta	Öl	1590, 1577, 1531, 1493,
11				1448, 1434, 1418, 1315,
				1188, 1165, 1127, 1034.
12	2-Methyl-phenyl	ortho	89-91°C	
13	4-Acetyl-phenyl	ortine	160-162°C	
13	4-(1-Methoxyiminoethyl)-	artho	105-107°C	
14	phenyl	ortho	100-107 0	
15	4-(1-Ethoxyiminoethyl)-	ortho	105-107°C	· •
	phenyl	Ortifo		
-	4-(1-iso-Propyloxyimino-	ortho	101-103°C	
16	ethyl)-phenyl			
17	-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	ortho	73-75°C	
18	2,2,2-Trifluorethoxy	ortho	145-147°C	
10	2,2,2 (111100100.00)			

Bsp.	X-R⁵	Position	Festpunkt	Spektroskopische Daten
19	2,2,3,3,3-	ortho	99-100°C	
	Pentafluorpropyloxy cyclo-Hexen-3-yl	ortho	87-89°C	
20	Phenyl	ortho	86-87°C	
22	4-iso-Propyl-phenyl	ortho	89-91°C	<u> </u>

Anwendungsbeispiele:

Die Wirkstoffe wurden als Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder Dimethylsulfoxid (DMSO). Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter. Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.



Wirksamkeit gegen Mehltau an Gurkenblättern verursacht durch Sphaerotheca,fuliginea bei protektiver Anwendung

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gurkenkeimlingen der Sorte "Chinesische Schlange" wurden im Keimblattstadium mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 20 h nach dem Antrocknen des Spritzbelags wurden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Gurkenmehltaus (Sphaerotheca fuliginea) inokuliert. Danach wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24 °C und 60 bis 80 % relativer Luftfeuchtigkeit für 7 Tage kultiviert. Danach wurde das Ausmaß der Mehltauentwicklung visuell in %-Befall der Keimblattfläche ermittelt. Die Ergebnisse sind in Tabelle 2 zusammengestellt.



Tabelle 2:

abelle 2:	Befall der Blattfläche [%]
Verbindung aus	beign der blattheter [1-]
Beispiel	bei 250 ppm Wirkstoffkonzentration
1	. 0
2	10
3	0
	0
4	0
5	0
6	0
7	1
8	

unbehandelt	90	;
22	0	<u> </u>
21	0	<u> </u>
20	1	
17	0	
16	0	
15	0	
14	0	
12	0	
Beispiel	bei 250 ppm Wirkstoffkonzentration	
Verbindung aus	Befall der Blattfläche [%]	

Protektive Wirksamkeit gegen Puccinia recondita an Weizen (Weizenbraunrost)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizensämlingen der Sorte "Kanzler" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe bestäubt. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit Sporen des Weizenbraunrostes (*Puccinia recondita*) bestäubt. Anschließend wurden die Pflanzen für 24 Stunden in eine Kammer mit hoher Luftfeuchtigkeit (90 bis 95 %) und 20 bis 22 °C gestellt. Während dieser Zeit keimten die Sporen aus und die Keimschläuche drangen in das Blattgewebe ein. Am folgenden Tag wurden die Versuchspflanzen ins Gewächshaus zurückgestellt und bei Temperaturen zwischen 20 und 22 °C und 65 bis 70 % relativer Luftfeuchtigkeit für weitere 7 Tage kultiviert. Danach wurde das Ausmaß der Rostpilzentwicklung auf den Blättern visuell ermittelt. Die Ergebnisse sind in Tabelle 3 zusammengestellt.

Tabelle 3:

Verbindung aus	Befall der Blattfläche [%]
Beispiel	bei 250 ppm Wirkstoffkonzentration
4	15
10	15
11	10
14	15
16	10
unbehandelt	90

Patentansprüche

3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I, 1.

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & N & W \\
R^2 & CF_3 & K^4
\end{array}$$

$$(I)$$

5

oder 4 steht und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

10

O, S oder direkte Bindung X

O oder S;

20

unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, C1-C4-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy

wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

Wasserstoff, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei wobei die Wasserstoffatome in den 3 zuletzt genannten Gruppen

teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₃-C₁₂-Alkinyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, wobei

die 5 letztgenannten Gruppen jeweils 1, 2 oder 3 Substituenten R9 aufweisen können, und wobei die Wasserstoffatome in den 5 letztgenannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substitu-

iert sein können;

C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₁-C₁₂-Alkyl, das 1, 2 oder 3 Substituenten R¹¹.

aufweist,

eine Gruppe -C(R10)=NOR8,

30

25

Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenyl-C₂-C₆-alkenyl, Phenyl-C₂-C₆alkinyl, Phenyloxy-C₁-C₆-alkyl, Phenyloxy-C₂-C₆-alkenyl, Phenyloxy-C₂-C₆-alkinyl, wobei der Alkyl-, Alkenyl- und der Alkinyl-Teil in den 6 zuletzt genannten Gruppen 1, 2, 3 oder 4 Substituenten R¹¹ aufwei-

20030975

 R^5

Wer/135

23.12.03

M/44344

sen kann und der Phenylring in den 7 zuletzt genannten Gruppen 1, 2, 3 oder 4 Reste R⁷ tragen kann;

R⁵

R⁷

5

10

15

n R

25

 R^9

R¹⁰

35

R¹¹

40

die für R¹ genannten, von Wasserstoff verschiedenen Bedeutungen; C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 - Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_2 - C_4 -Alkenyl, C_2 - C_4 -Alkenyloxy, C2-C4-Alkinyl, C2-C4-Alkinyloxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen 7 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können, OH, Halogen, Nitro, CN, C1-C4-Alkylthio, C1- C_4 -Alkylsulfonyl, $-C(O)R^{12}$, $NR^{13}R^{14}$, $-C(O)NR^{13}R^{14}$, $-C(S)NR^{13}R^{14}$, -C(R¹⁰)=NOR⁸, Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, Phenoxy, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, C₁-C₆-Alkyl-Phenyl, wobei die Wasserstoffatome des Alkylteils teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und der Phenylring 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, wobei zwei an benachbarte Kohlenstoffatome gebundene Reste R7 auch für eine Alkylenkette mit 3 bis 5 Gliedern stehen können, worin 1 oder 2 nicht benachbarte CH2-Gruppen auch durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein können und worin ein Teil oder alle Wasserstoffe durch Halogen ersetzt sein können;

 C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 - Cycloalkyl, C_2 - C_4 -Alkenyl, C_2 - C_4 -Alkinyl, wobei , wobei die Wasserstoffatome in diesen 4 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können,

Phenyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei Phenyl in den zwei letztgenannten Resten 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁶ genannten Gruppen aufweisen kann;

C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können; Wasserstoff, Halogen, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, wobei die Wasserstoffatome in den 9 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R⁷ genannten Gruppen aufweisen kann,

Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₂-C₈-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₈-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

15 .

30

35

3

- Wasserstoff, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, C₂-C₄-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 7 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;
- R¹³, R¹⁴ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;
- 10 und die landwirtschaftlich brauchbaren Salze von I.

- 2. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, worin R¹, R² und R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl bedeuten.
- 3. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, worin R¹, R² und R³ jeweils of the für Wasserstoff stehen.
- 4. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche,
 20 worin R⁴ ausgewählt ist unter Wasserstoff, Methyl, OH oder Methoxy.
 - 5. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 4, worin R⁴ für Wasserstoff steht.
- 25 6. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R⁵ eine der folgenden Bedeutungen aufweist:
 - unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₂-C₁₂-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und die Wasserstoffatome in C₃-C₁₂-Cycloalkyl teilweise oder vollständig durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können,
 - C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl;
 - Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei der Phenylring mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Resten R⁷ substituiert sein kann; oder
 - C(C₁-C₄-Alkyl)=NO-R⁸, wobei die Wasserstoffatome der C₁-C₄-Alkylgruppe teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können.

- Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, in denen R⁶ die folgenden Bedeutungen aufweist C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei diese Gruppen durch Halogen substituiert sein können, oder Halogen.
- 5 8. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, in denen n = 0 ist.
 - Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 9, worin R¹, R² und R³ jeweils für Wasserstoff stehen und die Gruppe X-R⁵ in ortho- oder meta-Position zum Amidstickstoff gebunden ist.
- 10. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, in denen X eine direkte Bindung oder Sauerstoff bedeutet.
 - 15. 11: Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 10, in denen die Gruppe X für Sauerstoff oder eine direkte Bindung steht und R⁵ eine der folgenden Bedeutungen aufweist:
 - unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₂-C₁₂-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und die Wasserstoffatome in C₃-C₁₂-Cycloalkyl teilweise oder vollständig durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können;
 - C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl;
 - Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei der Phenylring mit 1, 2, 3, 4 oder 5 Resten R⁷ substituiert sein kann; oder
 - -C(C₁-C₄-Alkyl)=NO-R⁸, wobei die Wasserstoffatome der C₁-C₄-Alkylgruppe teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können.
 - 12. Verwendung von 3-Trifluormethylpicolinsäureaniliden der allgemeinen Formel I und ihren landwirtschaftlich verträglichen Salzen gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Bekämpfung von Schadpilzen.
 - 35 13. Fungizide Mittel, enthaltend eine fungizid wirksame Menge mindestens eines 3-Trifluormethylpicolinsäureanilids der allgemeinen Formel I oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11.
 - Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man
 die Schadpilze, deren Lebensraum oder die von ihnen freizuhaltenden Pflanzen,

25

Flächen, Materialien oder Räume mit mindestens einer fungizid wirksamen Menge eines 3-Trifluormethylpicolinsäureanilids der allgemeinen Formel I oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 11 behandelt.

5



3-Trifluormethylpicolinsäureanilide und ihre Verwendung als Fungizide

Zusammenfassung

5 Die vorliegende Erfindung betrifft daher 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I,

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & W & (R^6)_n \\
R^2 & CF_3 & X-R^5 \\
R^3 & R^4 & X-R^5
\end{array}$$

worin X Sauerstoff, Schwefel oder eine direkte Bindung und W Sauerstoff oder Schwefel bedeuten, n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht und die Substituenten die in den Ansprüchen angegebene Bedeutung haben, und die landwirtschaftlich brauchbaren Salze von I.

Die vorliegende Erfindung betrifft außerdem die Verwendung der 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I und deren landwirtschaftlich verträglich Salze als Fungizide sowie diese enthaltende Pflanzenschutzmittel.

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record.

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

BLACK BORDERS
☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
☐ FADED TEXT OR DRAWING
☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
□ other:

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.